

**BUNDESREPUBLIK DEUTSCHLAND****PRIORITY  
DOCUMENT**SUBMITTED OR TRANSMITTED IN  
COMPLIANCE WITH RULE 17.1(a) OR (b)

REC'D 27 JAN 2005

WIPO

PCT

**Prioritätsbescheinigung über die Einreichung  
einer Patentanmeldung****Aktenzeichen:**

103 60 370.0

**Anmeldetag:**

22. Dezember 2003

**Anmelder/Inhaber:**

BAYER CropScience AG, 40789 Monheim/DE

**Bezeichnung:**

Triazolopyrimidine

**IPC:**

C 07 D, A 01 N

**Die angehefteten Stücke sind eine richtige und genaue Wiedergabe der ursprünglichen Unterlagen dieser Patentanmeldung.**

München, den 07. Oktober 2004  
**Deutsches Patent- und Markenamt**  
**Der Präsident**  
Im Auftrag

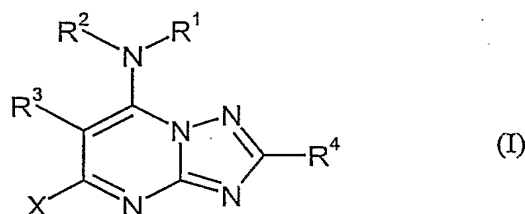
**Remus**

Triazolopyrimidine

Die Erfindung betrifft Triazolopyrimidine, ein Verfahren zu deren Herstellung und deren Verwendung zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen.

Es ist bereits bekannt geworden, dass bestimmte Triazolopyrimidine fungizide Eigenschaften besitzen (vgl. EP 0 550 113-A, WO 94-20 501, EP 0 613 900-A, US 5 612 345-A, EP 0 834 513-A, WO 98-46 607 und WO 98-46 608). Die Wirksamkeit dieser Stoffe ist gut, lässt aber bei niedrigen Aufwandmengen in manchen Fällen zu wünschen übrig.

Es wurden nun neue Triazolopyrimidine der Formel



10 in welcher

$R^1$  für H,  $R^2$ , gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Alkynyl, gegebenenfalls substituiertes Cyloalkyl oder für gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl steht;

15  $R^2$  für einen organischen Rest steht, der 3 bis 13 Kohlenstoffatome und ein oder mehrere Siliziumatome enthält, sowie gegebenenfalls 1 bis 3 gleiche oder verschiedene Heteroatome aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel, und unsubstituiert ist oder substituiert durch 1 bis 4 gleiche oder verschiedene Halogene; oder

$R^1$  und  $R^2$  gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen gegebenenfalls substituierten heterocyclischen Ring stehen, der ein oder mehrere Siliziumatome enthält  
20 und/oder durch einen oder mehrere Reste  $R^2$  substituiert ist;

$R^3$  für gegebenenfalls substituiertes Aryl, gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Alkynyl, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl, gegebenenfalls substituiertes Aralkyl, oder gegebenenfalls substituierte Aminogruppe, gegebenenfalls substituiertes (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkoxy, gegebenenfalls substituiertes (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylthio, gegebenenfalls substituiertes (C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)-Aryloxy, gegebenenfalls substituiertes (C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)-Arylthio,

25

gegebenenfalls substituiertes Heterocycloxy, gegebenenfalls substituiertes Heterocycloxy, gegebenenfalls substituiertes C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkoxy, gegebenenfalls substituiertes (C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)-Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkylthio, gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkoxy, oder gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkylthio;

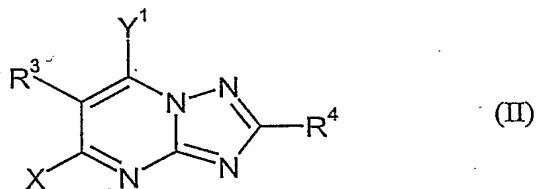
R<sup>4</sup> für H, Halogen, gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl oder gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Cycloalkyl steht und

X für Halogen, Cyano, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkoxy oder gegebenenfalls substituiertes Phenyl steht,

10 sowie deren Salze, gefunden.

Weiterhin wurde gefunden, dass sich Triazolopyrimidine der Formel (I) herstellen lassen, indem man

(a) Halogentriazolopyrimidine der Formel

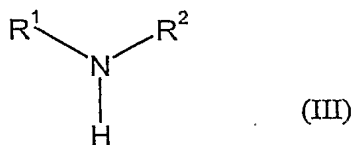


15 in welcher

R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> und X die oben angegebenen Bedeutungen haben und

Y¹ für Halogen steht,

mit Aminen der Formel



20 in welcher

R¹ und R² die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators umgesetzt.

- Schließlich wurde gefunden, dass sich die Triazolopyrimidine der Formel (I) sehr gut zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen eignen. Sie zeigen vor allem eine starke fungizide Wirksamkeit und lassen sich sowohl im Pflanzenschutz als auch im Materialschutz verwenden.

Überraschenderweise besitzen die erfindungsgemäßen Triazolopyrimidine der Formel (I) eine wesentlich bessere mikrobizide Wirksamkeit als die konstitutionell ähnlichsten, vorbekannten Stoffe gleicher Wirkungsrichtung.

- 10 Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) können gegebenenfalls als Mischungen verschiedener möglicher isomerer Formen, insbesondere von Stereoisomeren, wie E- und Z-, threo- und erythro-, sowie optischen Isomeren, wie R- und S-Isomeren oder Atropisomeren, gegebenenfalls aber auch von Tautomeren vorliegen.

Die erfindungsgemäßen Triazolopyrimidine sind durch die Formel (I) allgemein definiert.

- 15 Bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I), in denen

- a<sup>1</sup>) R<sup>3</sup> für gegebenenfalls substituiertes Aryl, oder
- a<sup>2</sup>) R<sup>3</sup> für gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl, oder
- a<sup>3</sup>) R<sup>3</sup> für gegebenenfalls substituiertes Alkyl, oder
- a<sup>4</sup>) R<sup>3</sup> für gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, oder
- 20 a<sup>5</sup>) R<sup>3</sup> für gegebenenfalls substituiertes Alkynyl, oder
- a<sup>6</sup>) R<sup>3</sup> für gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl, oder
- a<sup>7</sup>) R<sup>3</sup> für gegebenenfalls substituiertes Aralkyl, oder
- a<sup>8</sup>) R<sup>3</sup> für eine gegebenenfalls substituierte Aminogruppe steht.

- 25 Ebenso bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I), in denen R<sup>3</sup> eine der folgenden Bedeutungen hat:

b<sup>1</sup>: a<sup>1</sup>, a<sup>2</sup>, a<sup>3</sup>, a<sup>4</sup>, a<sup>5</sup>, a<sup>6</sup>, a<sup>7</sup>,

- b<sup>2</sup>: a<sup>1</sup>, a<sup>2</sup>, a<sup>3</sup>, a<sup>4</sup>, a<sup>5</sup>, a<sup>6</sup>, a<sup>8</sup>,  
 b<sup>3</sup>: a<sup>1</sup>, a<sup>2</sup>, a<sup>3</sup>, a<sup>4</sup>, a<sup>5</sup>, a<sup>7</sup>, a<sup>8</sup>,  
 b<sup>4</sup>: a<sup>1</sup>, a<sup>2</sup>, a<sup>3</sup>, a<sup>4</sup>, a<sup>6</sup>, a<sup>7</sup>, a<sup>8</sup>,  
 b<sup>5</sup>: a<sup>1</sup>, a<sup>2</sup>, a<sup>3</sup>, a<sup>5</sup>, a<sup>6</sup>, a<sup>7</sup>, a<sup>8</sup>,  
 5 b<sup>6</sup>: a<sup>1</sup>, a<sup>2</sup>, a<sup>4</sup>, a<sup>5</sup>, a<sup>6</sup>, a<sup>7</sup>, a<sup>8</sup>,  
 b<sup>7</sup>: a<sup>1</sup>, a<sup>3</sup>, a<sup>4</sup>, a<sup>5</sup>, a<sup>6</sup>, a<sup>7</sup>, a<sup>8</sup>,  
 b<sup>8</sup>: a<sup>2</sup>, a<sup>3</sup>, a<sup>4</sup>, a<sup>5</sup>, a<sup>6</sup>, a<sup>7</sup>, a<sup>8</sup>.

Weiterhin bevorzugt sind diejenigen Stoffe der Formel (I), in denen ein oder mehrere Symbole eine der im folgenden angegebenen bevorzugten Bedeutungen haben, d.h., in denen

- 10 R<sup>1</sup> für H steht, oder  
 R<sup>1</sup> für einen Rest R<sup>2</sup> steht, oder  
 R<sup>1</sup> für Alkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen steht, das einfach bis fünffach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Halogen, Cyano, Hydroxy, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, oder  
 15 R<sup>1</sup> für Alkenyl mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen steht, das einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Halogen, Cyano, Hydroxy, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, oder  
 R<sup>1</sup> für Alkynyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen steht, das einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Halogen, Cyano, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen, oder  
 20 R<sup>1</sup> für Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen steht, das einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Halogen und/oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, oder  
 R<sup>1</sup> für gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl mit 3 bis 8 Ringgliedern und 1 bis 3 Heteroatomen, wie Stickstoff, Sauerstoff und/oder Schwefel, steht, wobei das Heterocyclyl einfach oder zweifach substituiert sein kann durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cyano und/oder Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen,  
 25

- 5  $R^2$  für eine aliphatische, gesättigte oder ungesättigte Gruppe mit 1 bis 13 Kohlenstoffatomen und einem oder mehreren Siliziumatomen, die gegebenenfalls 1 bis 3 gleiche oder verschiedene Heteroatome aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff enthält und die unsubstituiert oder durch 1 bis 4 gleiche oder verschiedene Halogenatome substituiert ist, oder
- 10  $R^1$  und  $R^2$  gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen gesättigten oder ungesättigten heterocyclischen Ring mit 3 bis 8 Ringgliedern stehen, der ein oder mehrere Siliziumatome enthält und/oder durch einen oder mehrere Reste  $R^2$  substituiert ist, wobei der Heterocyclus ein weiteres Stickstoff-, Sauerstoff- oder Schwefelatom als Ringglied enthalten kann und wobei der Heterocyclus weiterhin bis zu dreifach substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 Fluor- und/oder Chloratomen,
- 15  $R^3$   $C_1$ - $C_{10}$ -Alkyl,  $C_2$ - $C_{10}$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_{10}$ -Alkinyl,  $C_3$ - $C_8$ -Cycloalkyl, Phenyl- $C_1$ - $C_{10}$ -alkyl, wobei  $R^3$  unsubstituiert oder teilweise oder vollständig halogeniert ist und/oder gegebenenfalls ein bis drei Reste aus der Gruppe  $R^X$  trägt, oder  $C_1$ - $C_{10}$ -Halogenalkyl, das gegebenenfalls ein bis drei Reste aus der Gruppe  $R^X$  trägt, und  $R^X$  Cyano, Nitro, Hydroxy,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Haloalkyl,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Haloalkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylthio,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkylthio,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylsulfinyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkylsulfinyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylsulfonyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkylsulfonyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylamino, Di-
- 20  $C_1$ - $C_6$ -alkylamino,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyloxy,  $C_2$ - $C_6$ -Alkinyl,  $C_3$ - $C_6$ -Alkinyl-oxy und gegebenenfalls halogeniertes Oxy- $C_1$ - $C_4$ -alkyl- $C_1$ - $C_4$ -alkenoxy, Oxy- $C_1$ - $C_4$ -alkenyl- $C_1$ - $C_4$ -alkoxy, Oxy- $C_1$ - $C_4$ -alkyl- $C_1$ - $C_4$ -alkyloxy bedeutet,
- 25  $R^3$  für Phenyl, das einfach bis vierfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl;
- jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen;
- jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl oder Alkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen;
- 30 jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkenyl oder Halogenalkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 11 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkylamino, Dialkylamino, Alkylcarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkoxycarbonyl, Alkylsulfonyloxy, Hydroximinoalkyl oder Alkoximinoalkyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen;

Cycloalkyl mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen;

in 2,3-Position verknüpftes 1,3-Propandiyl, 1,4-Butandiyl, Methylendioxy (-O-CH<sub>2</sub>-O-) oder 1,2-Ethylendioxy (-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-), wobei diese Reste einfach oder mehrfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

oder

R<sup>3</sup> für gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl mit 3 bis 8 Ringgliedern und 1 bis 3 Heteroatomen aus der Gruppe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel, wobei das Heterocyclyl einfach oder zweifach substituiert sein kann durch Halogen, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Haloalkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Haloalkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Cyano, Nitro und/oder Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen;

oder

R<sup>3</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinylamino, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkylamino, Di-C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-alkenylamino, Di-C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-alkinylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl-(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-alkinylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-alkylamino, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-alkylamino, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-Arylamino, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-alkylamino, C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-alkylamino, Heterocyclyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-alkylamino oder Heterocyclyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-alkylamino;

R<sup>4</sup> für H, Halogen, unsubstituiertes oder durch ein oder mehrere Halogenatome substituiertes (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl, unsubstituiertes oder durch ein oder mehrere Halogenatome substituiertes Cyclopropyl;

X für H, Fluor, Chlor, Brom oder CN steht.

Besonders bevorzugt sind diejenigen Triazolopyrimidine der Formel (I), in denen ein oder mehrere der Symbole eine der im folgenden aufgeführten besonders bevorzugten Bedeutungen haben, d.h., in denen

- $R^1$  für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl steht, oder
- 5  $R^2$  für eine Gruppe  $Y^2-Si(O_mCH_3)(O_nCH_3)(O_pY^3)$  steht,  
wobei m, n und p unabhängig voneinander 0 oder 1;
- 10  $Y^2$  eine Bindung oder Alkandiyl, Alkendiyl oder Alkindiyl, die jeweils geradkettig oder verzweigt sind, 1 bis 6, bzw. 2 bis 6 Kohlenstoffatome aufweisen, gegebenenfalls durch ein oder zwei nicht benachbarte Sauerstoffatome unterbrochen und unsubstituiert oder durch ein bis drei gleiche oder verschiedene Halogenatome substituiert sind;
- $Y^3$  geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkenyl mit 1 bis 5 bzw. 2 bis 5 Kohlenstoffatomen, gegebenenfalls durch ein Sauerstoff-Stickstoff- oder Schwefelatom unterbrochen und unsubstituiert oder durch 1 bis 3 gleiche oder verschiedene Halogenatome substituiert, bedeuten;
- 15  $R^3$  für  $(C_1-C_8)$ -Alkyl,  $(C_1-C_8)$ -Cycloalkyl, Benzyl oder
- $R^3$  für Phenyl, das einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch
- 20 Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Formyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Allyl, Propargyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Allyloxy, Propargyloxy, Trifluormethyl, Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Trichlorethinyloxy, Trifluorethinyloxy, Chlorallyloxy, Iodpropargyloxy, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl,
- 25 Ethoxycarbonyl, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl, Ethoximinoethyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl,
- in 2,3-Position verknüpftes 1,3-Propandiyl, 1,4-Butandiyl, Methylendioxy (-O-CH<sub>2</sub>-O-) oder 1,2-Ethylendioxy (-O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O-), wobei diese Reste einfach oder mehrfach,



gleichartig oder verschieden substituiert sein können durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl und/oder Trifluormethyl.

- 5  $R^3$  für Pyridyl, das in 2- oder 4-Stellung verknüpft ist und einfach bis vierfach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, Methoxy, Methylthio, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl, Methoximinoethyl und/oder Trifluormethyl, oder
- 10  $R^3$  für Pyrimidyl, das in 2- oder 4-Stellung verknüpft ist und einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, Methoxy, Methylthio, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl, Methoximinoethyl und/oder Trifluormethyl, oder
- $R^3$  für Thienyl, das in 2- oder 3-Stellung verknüpft ist und einfach bis dreifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, Methoxy, Methylthio, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl, Methoximinoethyl und/oder Trifluormethyl, oder
- 15  $R^3$  für  $C_1$ - $C_8$ -Alkylamino oder Di- $C_1$ - $C_8$ -alkylamino, oder
- $R^3$  für Thiazolyl, das in 2-, 4- oder 5-Stellung verknüpft ist und einfach bis zweifach, gleichartig oder verschieden substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, Methoxy, Methylthio, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl, Methoximinoethyl und/oder Trifluormethyl, oder
- 20  $R^3$  für N-Piperidiny, N-Tetrazolyl, N-Pyrazolyl, N-Imidazolyl, N-1,2,4-Triazolyl, N-Pyrrolyl, oder N-Morpholiny, die jeweils unsubstituiert oder ein- oder - falls möglich - mehrfach gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Methyl, Ethyl, Methoxy, Methylthio, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl, Methoximinoethyl und/oder Trifluormethyl substituiert sind,
- 25  $R^4$  für H, Cl, F,  $CH_3$ ,  $-CH(CH_3)_2$  oder Cyclopropyl; und
- X für H, F, Cl, CN, unsubstituiertes oder durch ein oder mehrere Fluor- oder Chloratome substituiertes  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl;

steht.

Ganz besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I), worin ein oder mehrere der Symbole eine der im folgenden aufgeführten ganz besonders bevorzugten Bedeutungen haben, in denen

- R<sup>1</sup> für H;
- 5 R<sup>2</sup> für SiMe<sub>3</sub>, SiMe<sub>2</sub>Et, SiMe<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>, SiMe<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>, SiMe<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CMe<sub>3</sub>,  
SiMe<sub>2</sub>OCHMe<sub>2</sub>, SiMe<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>SiMe<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>Et, CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>,  
CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CHMe, CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>OMe, CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>OCHMe<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>,  
CHMeSiMe<sub>3</sub>, CHMeSiMe<sub>2</sub>OMe, (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>SiMe<sub>3</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>Et, (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>,  
(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CMe<sub>3</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Me,  
10 (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CMe<sub>3</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>OCHMe<sub>2</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>,  
CHMeCH<sub>2</sub>SiMe<sub>3</sub>, CHMeCH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>Et, CHMeCH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Me,  
CHMeCH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>, CHMeCH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CMe<sub>3</sub>, CHMeCH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>,  
CFMeCH<sub>2</sub>SiMe<sub>3</sub>, CHMeCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>OMe, CHMeCH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>OCHMe<sub>2</sub>,  
CHMeCH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CHMeSiMe<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CHMeSiMe<sub>2</sub>Et,  
CH<sub>2</sub>CHMeSiMe<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>, CHMeCHMeSiMe<sub>3</sub>, CMe<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SiMe<sub>3</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>SiMe<sub>3</sub>,  
15 (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>SiMe<sub>2</sub>Et, (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>SiMe<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>SiMe<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>SiMe<sub>2</sub>OMe,  
(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>SiMe<sub>2</sub>OCHMe<sub>2</sub>, (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>SiMe<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>, CHMeCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SiMe<sub>3</sub>,  
CHMeCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>Et, CHMeCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>CHMe<sub>2</sub>,  
CHMeCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>OMe, CHMeCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>OCHMe<sub>2</sub>, CMe=CHSiMe<sub>3</sub>,  
CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SiMe<sub>2</sub>OMe, -C≡C-SiMe<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-C≡C-SiMe<sub>3</sub> oder -CHMe-C≡C-SiMe<sub>3</sub>;
- 20 R<sup>3</sup> für (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl, (C<sub>3</sub>-6)-Alkenyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkynyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl, wobei R<sup>3</sup>  
unsubstituiert oder durch ein oder mehrere Fluor- oder Chloratome substituiert ist,  
oder
- R<sup>3</sup> für 2,4- oder 2,6-disubstituiertes Phenyl, oder für 2-substituiertes Phenyl oder für 2,4,6-  
trisubstituiertes Phenyl,
- 25 R<sup>3</sup> für Pyridyl, das in 2- oder 4-Stellung verknüpft ist und einfach bis vierfach, gleichartig  
oder verschieden substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Methyl, Ethyl,  
Methoxy, Methylthio, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl,  
Methoximinoethyl und/oder Trifluormethyl, oder
- R<sup>3</sup> für Pyrimidyl, das in 4-Stellung verknüpft ist und einfach bis dreifach, gleichartig oder  
30 verschieden substituiert sein kann durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Methyl, Ethyl,

Methoxy, Methylthio, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl, Methoximinoethyl und/oder Trifluormethyl;

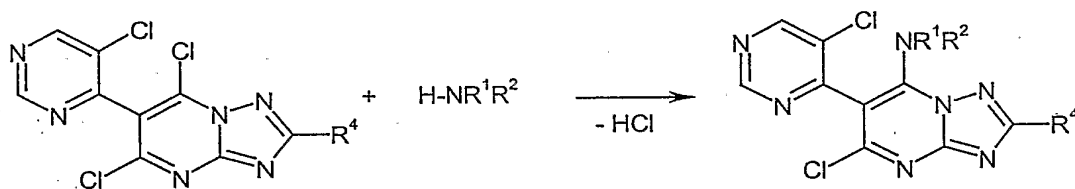
$R^4$  für H,  $-CH_3$ ,  $-CH(CH_3)_2$ , Cl oder Cyclopropyl,

und

5 X für Fluor, Chlor,  $(C_1-C_7)$ -Alkyl oder  $(C_1-C_3)$ -Haloalkyl steht.

Die zuvor genannten Reste-Definitionen können untereinander in beliebiger Weise kombiniert werden. Außerdem können einzelne Definitionen entfallen.

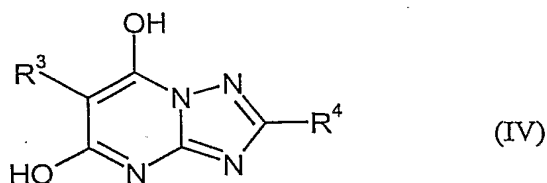
Verwendet man beispielsweise 5,7-Dichlor-6-(5-chlorpyrimidin-4-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin als Ausgangsstoff, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) durch das  
10 folgende Formelschema veranschaulicht werden.



Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) als Ausgangsstoffe benötigten Dihalogen-triazolo-pyrimidine sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In dieser Formel (II) haben  $R^3$  und X vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der  
15 Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt genannt wurden.  $Y^1$  steht vorzugsweise für Fluor, Chlor oder Brom, besonders bevorzugt für Fluor oder Chlor.

Dihalogen-triazolopyrimidine lassen sich herstellen, indem man beispielsweise

(b) Dihydroxy-triazolo-pyrimidine der Formel



20

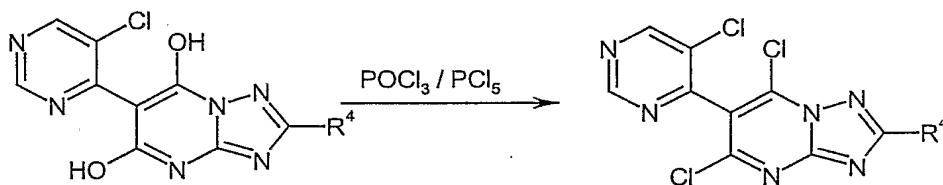
in welcher

$R^3$  die oben angegebene Bedeutung hat,

mit Halogenierungsmitteln, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt.

Verwendet man beispielsweise 6-(5-Chlorpyrimidin-4-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]-pyrimidin-5,7-diol als Ausgangsstoff und Phosphoroxychlorid im Gemisch mit Phosphorpentachlorid als Halogenierungsmittel, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) durch das folgende

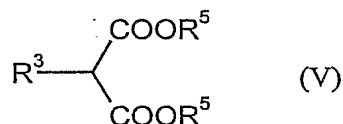
5 Formelschema veranschaulicht werden.



Die bei der Durchführung des Verfahrens (b) als Ausgangsstoffe benötigten Dihydroxy-triazolopyrimidine sind durch die Formel (IV) allgemein definiert. In dieser Formel hat  $R^3$  vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diesen Rest als bevorzugt genannt wurden.

Dihydroxy-triazolopyrimidine der Formel (IV) lassen sich herstellen, indem man beispielsweise

(c) Heteroarylmalonester der Formel

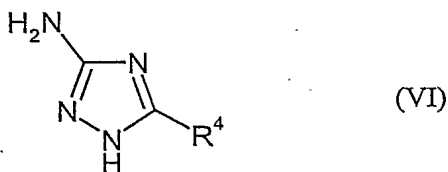


in welcher

15  $R^3$  die oben angegebene Bedeutung hat und

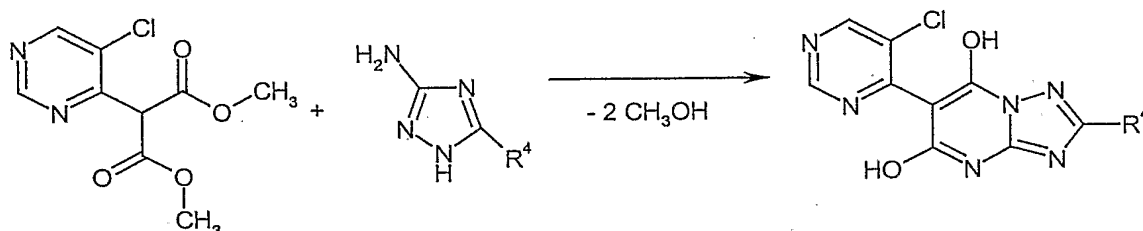
$R^5$  für Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht,

mit einem Aminotriazol der Formel



gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umgesetzt.

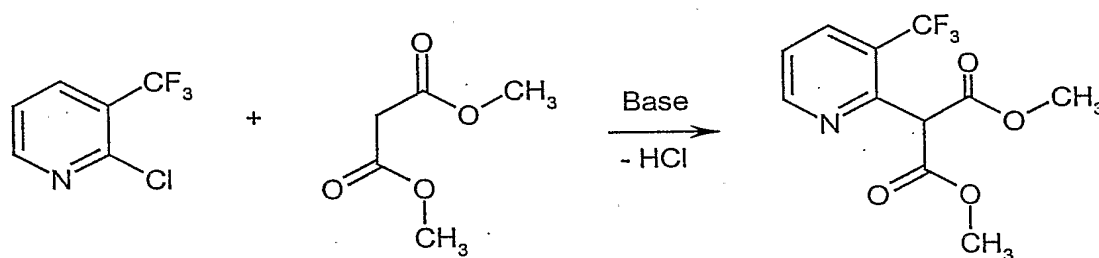
Verwendet man beispielsweise 2-(5-Chlorpyrimidin-4-yl)-malonsäuredimethylester und ein 3-Aminotriazol als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



5 Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) als Ausgangsstoffe benötigten Heteroarylmalonester sind durch die Formel (V) allgemein definiert. In dieser Formel hat  $R^3$  vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diesen Rest als bevorzugt genannt wurden.  $R^5$  steht für Methyl oder Ethyl.

10 Die Heteroarylmalonester der Formel (V) sind bekannt (vgl. DE 38 20 538-A, WO 01-11 965 und DE-A 103 25 133).

Verwendet man beispielsweise 2-Chlor-3-trifluormethylpyridin und Malonsäuredimethylester als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (d) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

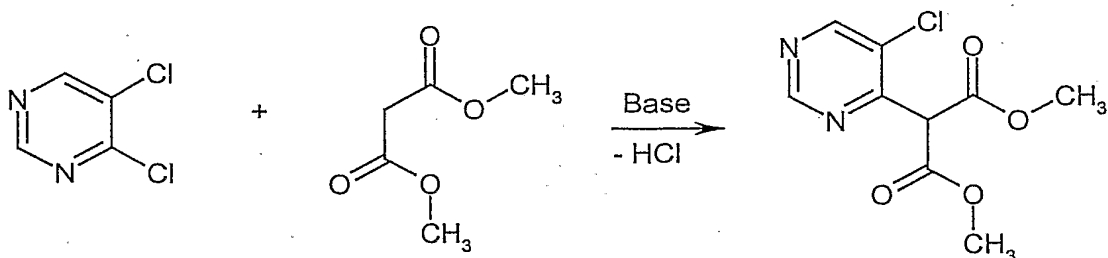


15

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (d) als Ausgangsstoffe benötigten Halogenpyridine sind bekannte Syntheschemikalien.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (d) weiterhin als Ausgangsstoffe benötigten Malonsäureester sind ebenfalls bekannte Syntheschemikalien.

20 Verwendet man beispielsweise 4,5-Dichlorpyrimidin und Malonsäuredimethylester als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (e) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (e) als Ausgangsstoffe benötigten Halogenpyrimidine sind bekannt und können nach bekannten Methoden hergestellt werden (vgl. J. Chem. Soc. 1955, 3478, 3481).

- 5 Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) als Ausgangsstoff weiterhin benötigten Aminotriazole der Formel (VI) sind handelsübliche Chemikalien.

- Als Halogenierungsmittel kommen bei der Durchführung des Verfahrens (b) alle für den Ersatz von Hydroxygruppen durch Halogen üblichen Komponenten in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind Phosphortrichlorid, Phosphortribromid, Phosphorpentachlorid, Phosphoroxychlorid, Thionylchlorid, Thionylbromid, Phosgen, Diphosgen, Triphosgen oder deren Gemische, insbesondere eine Mischung aus Phosphoroxychlorid, Phosphortrichlorid und Chlor (siehe z.B. EP-A 1 077 210). Die entsprechenden Fluor-Verbindungen der Formel (II) lassen sich aus den Chlor- oder Brom-Verbindungen durch Umsetzung mit Kaliumfluorid herstellen.
- 10

Die genannten Halogenierungsmittel sind bekannt.

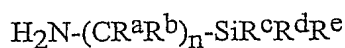
- 15 Die weiterhin zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) als Ausgangsstoffe benötigten Amine sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In dieser Formel haben  $R^1$  und  $R^2$  vorzugsweise diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für  $R^1$  und  $R^2$  als bevorzugt angegeben wurden.

- Die Synthese von Verbindungen der Formel (II), in denen  $R^3$  eine Alkyl-, Alkenyl-, Alkynyl- oder Cycloalkylgruppe ist, ist in der WO-A 03/009687 beschrieben.
- 20

Die Synthese von Verbindungen der Formel (II), in denen  $R^3$  eine Amino-, Alkohol- oder Thiofunktion trägt, ist in der WO-A 03/039 259 beschrieben.

Die Amine der Formel (III) sind bekannt. Sie sind teilweise käuflich erhältlich oder lassen sich nach bekannten, dem Fachmann geläufigen Methoden herstellen.

- 25 So sind silylierte Amine der Formel (IIIa)

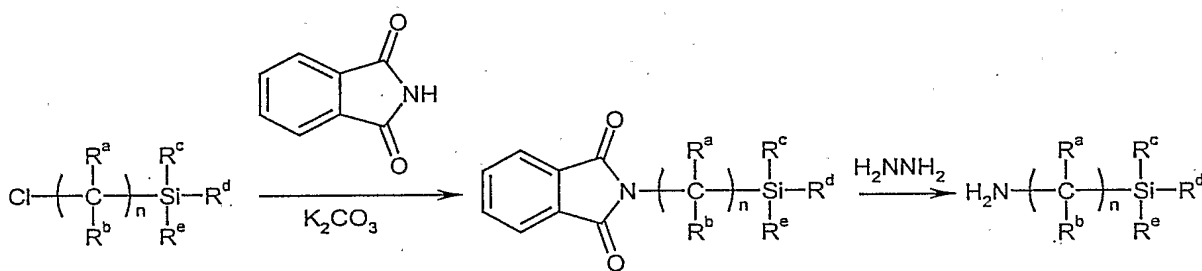


worin

n eine natürliche Zahl von 0 bis 10 und

$\text{R}^a, \text{R}^b, \text{R}^c, \text{R}^d$  gleich oder verschieden H,  $\text{CH}_3$  oder  $\text{C}_2\text{H}_5$  bedeutet (wobei die Gesamtzahl der C-Atome in  $\text{R}^{a-d} \leq 12$  ist),

allgemein zugänglich, indem man beispielsweise Phthalimid in Gegenwart einer Base, wie  $\text{K}_2\text{CO}_3$ , mit einem Halogenalkylsilan umsetzt und das entstandene N-substituierte Phthalimid mit Hydrazin spaltet:



Solche Synthesen sind beispielsweise beschrieben in J. Am. Chem. Soc. 1951, 73, 5130 oder J. Organomet. Chem. 1978, 174, C18.

Haloalkylsilane sind käuflich oder können nach bekannten, dem Fachmann geläufigen Methoden hergestellt werden (siehe z.B. Houben-Weyl, Band 13/5, S. 65 ff. oder Science of Synthesis, Vol. 4, S. 247 ff.).

Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) alle üblichen inerten organischen Solventien in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid; Sulfone, wie Sulfolan.

Als Säureakzeptoren kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) alle für derartige Umsetzungen üblichen anorganischen oder organischen Basen in Frage. Vorzugsweise

verwendbar sind Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie beispielsweise Natriumhydrid, Natriumamid, Lithium-diisopropylamid, Natrium-methylat, Natrium-ethylat, Kalium-tert.-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat und Natriumhydrogencarbonat, und außerdem Ammonium-Verbindungen wie Ammoniumhydroxid, Ammoniumacetat und Ammoniumcarbonat, sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

Als Katalysatoren kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) alle für derartige Umsetzungen üblichen Reaktionsbeschleuniger in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind Fluoride wie Natriumfluorid, Kaliumfluorid oder Ammoniumfluorid.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) in einem größeren Bereich variiert werden. Im Allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen zwischen 0°C und 80°C.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) setzt man auf 1 mol an Dihalogentriazolo-pyrimidin der Formel (II) im Allgemeinen 0,5 bis 10 mol, vorzugsweise 0,8 bis 2 mol an Amin der Formel (III) ein. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden.

Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) alle für derartige Halogenierungen üblichen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind halogenierte aliphatische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzol. Als Verdünnungsmittel kann aber auch das Halogenierungsmittel selbst, z.B. Phosphoroxychlorid oder ein Gemisch von Halogenierungsmitteln fungieren.

Die Temperaturen können auch bei der Durchführung des Verfahrens (b) in einem größeren Bereich variiert werden. Im Allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C, vorzugsweise zwischen 10°C und 120°C.

Bei der Durchführung des Verfahrens (b) setzt man Dihydroxy-triazolpyrimidin der Formel (IV) im Allgemeinen mit einem Überschuss an Halogenierungsmittel um. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden.



Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des Verfahrens (c) alle für derartige Umsetzungen üblichen, inerten organischen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n-Propanol, i-Propanol, n-Butanol und tert.-Butanol.

- 5 Als Säurebindemittel kommen bei der Durchführung des Verfahrens (c) alle für derartige Umsetzungen üblichen anorganischen und organischen Basen in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind tertiäre Amine, wie Tributylamin oder Pyridin. Im Überschuss eingesetztes Amin kann auch als Verdünnungsmittel fungieren.

- 10 Die Temperaturen können bei der Durchführung des Verfahrens (c) in einem größeren Bereich variiert werden. Im Allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 20°C und 200°C, vorzugsweise zwischen 50°C und 180°C.

Bei der Durchführung des Verfahrens (c) setzt man Heteroarylmalonester der Formel (V) und Aminotriazol der Formel (VI) im Allgemeinen in äquivalenten Mengen um. Es ist aber auch möglich, die eine oder andere Komponente in einem Überschuss zu verwenden. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden.

- 15 Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (d) und (e) jeweils alle üblichen, inerten organischen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid; Sulfone, wie Sulfolan; Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n- oder i-Propanol, n-, i-, sek- oder tert-Butanol, Ethandiol, Propan-1,2-diol, Ethoxyethanol, Methoxyethanol, Diethylen-  
20 glykolmonomethylether, Diethylenglykolmonoethylether, deren Gemische mit Wasser oder auch  
25 reines Wasser.

Als Kupfersalze kommen bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (d) und (e) jeweils übliche Kupfersalze in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind Kupfer(I)chlorid oder Kupfer(I)bromid.

- 30 Als Säureakzeptoren kommen bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (d) und (e) jeweils alle üblichen anorganischen oder organischen Basen in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate,

-carbonate oder -hydrogencarbonate, wie beispielsweise Natriumhydrid, Natriumamid, Lithium-diisopropylamid, Natrium-methylat, Natrium-ethylat, Kalium-tert.-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat und Natriumhydrogencarbonat und außerdem Ammoniumverbindungen wie Ammoniumhydroxid, Ammoniumacetat und Ammoniumcarbonat, sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

Die Reaktionstemperaturen können auch bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (d) und (e) in einem größeren Bereich variiert werden. Im Allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen zwischen 0°C und 80°C.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (d) setzt man auf 1 Mol an Halogenpyridin im Allgemeinen 1 bis 15 Mol, vorzugsweise 1,3 bis 8 Mol an Malonester ein. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (e) setzt man auf 1 Mol an Halogenpyrimidin im Allgemeinen 1 bis 15 Mol, vorzugsweise 1,3 bis 8 Mol an Malonester ein. Die Aufarbeitung erfolgt wiederum nach üblichen Methoden.

Die erfindungsgemäßen Verfahren werden im Allgemeinen unter Atmosphärendruck durchgeführt. Es ist jedoch auch möglich, unter erhöhtem oder vermindertem Druck zu arbeiten.

Die erfindungsgemäßen Stoffe weisen eine starke mikrobizide Wirkung auf und können zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, wie Fungi und Bakterien, im Pflanzenschutz und im Materialschutz eingesetzt werden.

Fungizide lassen sich Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Plasmodiophoromycetes, Oomycetes, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes und Deuteromycetes einsetzen.

Bakterizide lassen sich im Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Pseudomonadaceae, Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae und Streptomycetaceae einsetzen.

Beispielhaft aber nicht begrenzend seien einige Erreger von pilzlichen und bakteriellen Erkrankungen, die unter die oben aufgezählten Oberbegriffe fallen, genannt:

Xanthomonas-Arten, wie beispielsweise Xanthomonas campestris pv. oryzae;

- Pseudomonas-Arten, wie beispielsweise *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*;
- Erwinia-Arten, wie beispielsweise *Erwinia amylovora*;
- Pythium-Arten, wie beispielsweise *Pythium ultimum*;
- Phytophthora-Arten, wie beispielsweise *Phytophthora infestans*;
- 5 Pseudoperonospora-Arten, wie beispielsweise *Pseudoperonospora humuli* oder  
*Pseudoperonospora cubensis*;
- Plasmopara-Arten, wie beispielsweise *Plasmopara viticola*;
- Bremia-Arten, wie beispielsweise *Bremia lactucae*;
- Peronospora-Arten, wie beispielsweise *Peronospora pisi* oder *P. brassicae*;
- 10 Erysiphe-Arten, wie beispielsweise *Erysiphe graminis*;
- Sphaerotheca-Arten, wie beispielsweise *Sphaerotheca fuliginea*;
- Podosphaera-Arten, wie beispielsweise *Podosphaera leucotricha*;
- Venturia-Arten, wie beispielsweise *Venturia inaequalis*;
- Pyrenophora-Arten, wie beispielsweise *Pyrenophora teres* oder *P. graminea*
- 15 (Konidienform: *Drechslera*, Syn: *Helminthosporium*);
- Cochliobolus*-Arten, wie beispielsweise *Cochliobolus sativus*
- (Konidienform: *Drechslera*, Syn: *Helminthosporium*);
- Uromyces*-Arten, wie beispielsweise *Uromyces appendiculatus*;
- Puccinia*-Arten, wie beispielsweise *Puccinia recondita*;
- 20 *Sclerotinia*-Arten, wie beispielsweise *Sclerotinia sclerotiorum*;
- Tilletia*-Arten, wie beispielsweise *Tilletia caries*;
- Ustilago*-Arten, wie beispielsweise *Ustilago nuda* oder *Ustilago avenae*;

Pellicularia-Arten, wie beispielsweise *Pellicularia sasakii*;

Pyricularia-Arten, wie beispielsweise *Pyricularia oryzae*;

Fusarium-Arten, wie beispielsweise *Fusarium culmorum*;

Botrytis-Arten, wie beispielsweise *Botrytis cinerea*;

5    Septoria-Arten, wie beispielsweise *Septoria nodorum*;

Leptosphaeria-Arten, wie beispielsweise *Leptosphaeria nodorum*;

Cercospora-Arten, wie beispielsweise *Cercospora canescens*;

Alternaria-Arten, wie beispielsweise *Alternaria brassicae*;

Pseudocercospora-Arten, wie beispielsweise *Pseudocercospora herpotrichoides*.

10    Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe weisen auch eine sehr gute stärkende Wirkung in Pflanzen auf. Sie eignen sich daher zur Mobilisierung pflanzeigener Abwehrkräfte gegen Befall durch unerwünschte Mikroorganismen.

Unter pflanzenstärkenden (resistenzinduzierenden) Stoffen sind im vorliegenden Zusammenhang solche Substanzen zu verstehen, die in der Lage sind, das Abwehrsystem von Pflanzen so zu  
15    stimulieren, dass die behandelten Pflanzen bei nachfolgender Inokulation mit unerwünschten Mikroorganismen weitgehende Resistenz gegen diese Mikroorganismen entfalten.

Unter unerwünschten Mikroorganismen sind im vorliegenden Fall phytopathogene Pilze, Bakterien und Viren zu verstehen. Die erfindungsgemäßen Stoffe können also eingesetzt werden, um Pflanzen innerhalb eines gewissen Zeitraumes nach der Behandlung gegen den Befall durch  
20    die genannten Schaderreger zu schützen. Der Zeitraum, innerhalb dessen Schutz herbeigeführt wird, erstreckt sich im allgemeinen von 1 bis 10 Tage, vorzugsweise 1 bis 7 Tage nach der Behandlung der Pflanzen mit den Wirkstoffen.

Die gute Pflanzenverträglichkeit der Wirkstoffe in den zur Bekämpfung von Pflanzenkrankheiten notwendigen Konzentrationen erlaubt eine Behandlung von oberirdischen Pflanzenteilen, von  
25    Pflanz- und Saatgut, und des Bodens.

Dabei lassen sich die erfindungsgemäßen Wirkstoffe mit besonders gutem Erfolg zur Bekämpfung von Getreidekrankheiten, wie beispielsweise gegen Erysiphe-Arten, von Krankheiten im Wein-,

Obst- und Gemüseanbau, wie beispielsweise gegen Botrytis-, Venturia-, Sphaerotheca- und Podosphaera-Arten, einsetzen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich auch zur Steigerung des Ernteertrages. Sie sind außerdem mindertoxisch und weisen eine gute Pflanzenverträglichkeit auf.

- 5 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können gegebenenfalls in bestimmten Konzentrationen und Aufwandmengen auch als Herbizide, zur Beeinflussung des Pflanzenwachstums, sowie zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen verwendet werden. Sie lassen sich gegebenenfalls auch als Zwischen- und Vorprodukte für die Synthese weiterer Wirkstoffe einsetzen.

- 10 Erfindungsgemäß können alle Pflanzen und Pflanzenteile behandelt werden. Unter Pflanzen werden hierbei alle Pflanzen und Pflanzenpopulationen verstanden, wie erwünschte und unerwünschte Wildpflanzen oder Kulturpflanzen (einschließlich natürlich vorkommender Kulturpflanzen). Kulturpflanzen können Pflanzen sein, die durch konventionelle Züchtungs- und Optimierungsmethoden oder durch biotechnologische und gentechnologische Methoden oder Kombinationen dieser Methoden erhalten werden können, einschließlich der transgenen Pflanzen
- 15 und einschließlich der durch Sortenschutzrechte schützbaren oder nicht schützbaren Pflanzensorten. Unter Pflanzenteilen sollen alle oberirdischen und unterirdischen Teile und Organe der Pflanzen, wie Spross, Blatt, Blüte und Wurzel verstanden werden, wobei beispielhaft Blätter, Nadeln, Stängel, Stämme, Blüten, Fruchtkörper, Früchte und Samen sowie Wurzeln, Knollen und Rhizome aufgeführt werden. Zu den Pflanzenteilen gehört auch Erntegut sowie vegetatives und
- 20 generatives Vermehrungsmaterial, beispielsweise Stecklinge, Knollen, Rhizome, Ableger und Samen.

- Die erfindungsgemäße Behandlung der Pflanzen und Pflanzenteile mit den Wirkstoffen erfolgt direkt oder durch Einwirkung auf deren Umgebung, Lebensraum oder Lagerraum nach den üblichen Behandlungsmethoden, z.B. durch Tauchen, Sprühen, Verdampfen, Vernebeln, Streuen,
- 25 Aufstreichen und bei Vermehrungsmaterial, insbesondere bei Samen, weiterhin durch ein- oder mehrschichtiges Umhüllen.

Im Materialschutz lassen sich die erfindungsgemäßen Stoffe zum Schutz von technischen Materialien gegen Befall und Zerstörung durch unerwünschte Mikroorganismen einsetzen.

- 30 Unter technischen Materialien sind im vorliegenden Zusammenhang nichtlebende Materialien zu verstehen, die für die Verwendung in der Technik zubereitet worden sind. Beispielsweise können technische Materialien, die durch erfindungsgemäße Wirkstoffe vor mikrobieller Veränderung oder Zerstörung geschützt werden sollen, Klebstoffe, Leime, Papier und Karton, Textilien, Leder,

Holz, Anstrichmittel und Kunststoffartikel, Kühlschmierstoffe und andere Materialien sein, die von Mikroorganismen befallen oder zersetzt werden können. Im Rahmen der zu schützenden Materialien seien auch Teile von Produktionsanlagen, beispielsweise Kühlwasserkreisläufe, genannt, die durch Vermehrung von Mikroorganismen beeinträchtigt werden können. Im Rahmen der  
5 vorliegenden Erfindung seien als technische Materialien vorzugsweise Klebstoffe, Leime, Papiere und Kartone, Leder, Holz, Anstrichmittel, Kühlschmiermittel und Wärmeübertragungsflüssigkeiten genannt, besonders bevorzugt Holz.

Als Mikroorganismen, die einen Abbau oder eine Veränderung der technischen Materialien bewirken können, seien beispielsweise Bakterien, Pilze, Hefen, Algen und Schleimorganismen  
10 genannt. Vorzugsweise wirken die erfindungsgemäßen Wirkstoffe gegen Pilze, insbesondere Schimmelpilze, holzverfärbende und holzzerstörende Pilze (Basidiomyceten) sowie gegen Schleimorganismen und Algen.

Es seien beispielsweise Mikroorganismen der folgenden Gattungen genannt:

- Alternaria, wie *Alternaria tenuis*,
- 15 Aspergillus, wie *Aspergillus niger*,
- Chaetomium, wie *Chaetomium globosum*,
- Coniophora, wie *Coniophora puetana*,
- Lentinus, wie *Lentinus tigrinus*,
- Penicillium, wie *Penicillium glaucum*,
- 20 Polyporus, wie *Polyporus versicolor*,
- Aureobasidium, wie *Aureobasidium pullulans*,
- Sclerophoma, wie *Sclerophoma pityophila*,
- Trichoderma, wie *Trichoderma viride*,
- Escherichia, wie *Escherichia coli*,
- 25 Pseudomonas, wie *Pseudomonas aeruginosa*,
- Staphylococcus, wie *Staphylococcus aureus*.

Die Wirkstoffe können in Abhängigkeit von ihren jeweiligen physikalischen und/ oder chemischen Eigenschaften in die üblichen Formulierungen überführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Pulver, Schäume, Pasten, Granulate, Aerosole, Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen und in Hüllmassen für Saatgut, sowie ULV-Kalt- und Warmnebel-Formulierungen.

- 5 Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln, unter Druck stehenden verflüssigten Gasen und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaumerzeugenden Mitteln. Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel
- 10 als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im Wesentlichen infrage: Aromaten, wie Xylol, Toluol oder Alkylnaphthaline, chlorierte Aromaten oder chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, Alkohole, wie Butanol oder Glycol sowie deren Ether und Ester, Ketone, wie Aceton, Methylethylketon, Methyl-
- 15 isobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser. Mit verflüssigten gasförmigen Streckmitteln oder Trägerstoffen sind solche Flüssigkeiten gemeint, welche bei normaler Temperatur und unter Normaldruck gasförmig sind, z.B. Aerosol-Treibgase, wie Halogenkohlenwasserstoffe sowie Butan, Propan, Stickstoff und Kohlendioxid. Als feste Trägerstoffe kommen in Frage: z.B. natürliche Gesteinsmehle, wie
- 20 Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate. Als feste Trägerstoffe für Granulate kommen infrage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Bims, Marmor, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnussschalen, Maiskolben und Tabakstängel. Als Emulgier und/oder schaumerzeugende Mittel kommen
- 25 infrage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäureester, Polyoxyethylen-Fettalkoholether, z.B. Alkylarylpolyglycolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate. Als Dispergiermittel kommen infrage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.
- 30 Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulverige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kephaline und Lecithine, und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyankblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyaninfarbstoffe und Spurennährstoffe, wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

- 5 Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

- 10 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Fungiziden, Bakteriziden, Akariziden, Nematiziden oder Insektiziden verwendet werden, um so z.B. das Wirkungsspektrum zu verbreitern oder Resistenzentwicklungen vorzubeugen. In vielen Fällen erhält man dabei synergistische Effekte, d.h. die Wirksamkeit der Mischung ist größer als die Wirksamkeit der Einzelkomponenten.

Als Mischpartner kommen zum Beispiel folgende Verbindungen infrage:

**Fungizide:**

2-Phenylphenol; 8-Hydroxychinolinsulfat;

- 15 Acibenzolar-S-methyl; Aldimorph; Amidoflumet; Ampropylfos; Ampropylfos-potassium; Andoprim; Anilazine; Azaconazole; Azoxystrobin;

Benalaxyl; Benodanil; Benomyl; Benthiavalicarb-isopropyl; Benzamacril; Benzamacril-isobutyl; Bilanafos; Binapacryl; Biphenyl; Bitertanol; Blasticidin-S; Bromuconazole; Bupirimate; Buthiobate; Butylamin;

- 20 Calcium-polysulfide; Capsimycin; Captafol; Captan; Carbendazim; Carboxin; Carpropamid; Carvone; Chinomethionat; Chlobenthiazole; Chlorfenazole; Chloroneb; Chlorothalonil; Chlozolate; Clozylacon; Cyazofamid; Cyflufenamid; Cymoxanil; Cyproconazole; Cyprodinil; Cyprofuram;

- 25 Dagger G; Debacarb; Dichlofluand; Dichlone; Dichlorophen; Diclocymet; Diclomezine; Dicloran; Diethofencarb; Difenoconazole; Diflumentorim; Dimethirimol; Dimethomorph; Dimoxystrobin; Diniconazole; Diniconazole-M; Dinocap; Diphenylamine; Dipyrithione; Ditalimfos; Dithianon; Dodine; Drazoxolon;

Edifenphos; Epoxiconazole; Ethaboxam; Ethirimol; Etridiazole;



- Famoxadone; Fenamidone; Fenapanil; Fenarimol; Fenbuconazole; Fenfuram; Fenhexamid; Fenitropan; Fenoxanil; Fempiclonil; Fenpropidin; Fenpropimorph; Ferbam; Fluazinam; Flubenzimine; Fludioxonil; Flumetover; Flumorph; Fluoromide; Fluoxastrobin; Fluquinconazole; Flurprimidol; Flusilazole; Flusulfamide; Flutolanil; Flutriafol; Folpet; Fosetyl-Al; Fosetyl-sodium;
- 5 Fuberidazole; Furalaxyl; Furametpyr; Furcarbanil; Furmecyclox;
- Guazatine;
- Hexachlorobenzene; Hexaconazole; Hymexazol;
- Imazalil; Imibenconazole; Iminoctadine triacetate; Iminoctadine tris(albesil; Iodocarb; Ipconazole; Iprobenfos; Iprodione; Iprovalicarb; Irumamycin; Isoprothiolane; Isovaledione;
- 10 Kasugamycin; Kresoxim-methyl;
- Mancozeb; Maneb; Meferimzone; Mepanipyrim; Mepronil; Metalaxyl; Metalaxyl-M; Metconazole; Methasulfocarb; Methfuroxam; Metiram; Metominostrobin; Metsulfovax; Mildiomycin; Myclobutanil; Myclozolin;
- Natamycin; Nicobifen; Nitrothal-isopropyl; Noviflumuron; Nuarimol;
- 15 Ofurace; Orysastrobin; Oxadixyl; Oxolinic acid; Oxpoconazole; Oxycarboxin; Oxyfenthiin;
- Paclobutrazol; Pefurazoate; Penconazole; Pencycuron; Phosdiphen; Phthalide; Picoxystrobin; Piperalin; Polyoxins; Polyoxorim; Probenazole; Prochloraz; Procymidone; Propamocarb; Propanosine-sodium; Propiconazole; Propineb; Proquinazid; Prothioconazole; Pyraclostrobin; Pyrazophos; Pyrifenox; Pyrimethanil; Pyroquilon; Pyroxyfur; Pyrrolnitrine;
- 20 Quinconazole; Quinoxifen; Quintozene;
- Simeconazole; Spiroxamine; Sulfur;
- Tebuconazole; Tecloftalam; Tecnazene; Tetcyclacis; Tetraconazole; Thiabendazole; Thicyofen; Thifluzamide; Thiophanate-methyl; Thiram; Tioxymid; Tolclofos-methyl; Tolyfluanid; Triadimefon; Triadimenol; Triazbutil; Triazoxide; Tricyclamide; Tricyclazole; Tridemorph;
- 25 Trifloxystrobin; Triflumizole; Triforine; Triticonazole;
- Uniconazole;
- Validamycin A; Vinclozolin;

Zineb; Ziram; Zoxamide;

(2S)-N-[2-[4-[[3-(4-Chlorphenyl)-2-propinyl]oxy]-3-methoxyphenyl]ethyl]-3-methyl-2-[(methylsulfonyl)amino]-butanamid;

1-(1-Naphthalenyl)-1H-pyrrol-2,5-dion;

5 2,3,5,6-Tetrachlor-4-(methylsulfonyl)-pyridin;

2-Amino-4-methyl-N-phenyl-5-thiazolcarboxamid;

2-Chlor-N-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-pyridincarboxamid;

3,4,5-Trichlor-2,6-pyridindicarbonitril;

Actinovate;

10 cis-1-(4-Chlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-cycloheptanol;

Methyl 1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazol-5-carboxylat;

Monokaliumcarbonat;

N-(6-Methoxy-3-pyridinyl)-cyclopropancarboxamid;

Natriumtetrathiocarbonat;

15 sowie Kupfersalze und -zubereitungen, wie Bordeaux mixture; Kupferhydroxid; Kupfer-naphthenat; Kupferoxychlorid; Kupfersulfat; Cufraneb; Kupferoxid; Mancopper; Oxine-copper.

**Bakterizide:**

Bronopol, Dichlorophen, Nitrapyrin, Nickel-dimethyldithiocarbamat, Kasugamycin, Oethilnon, Furancarbonsäure, Oxytetracyclin, Probenazol, Streptomycin, Tecloftalam, Kupfersulfat und  
20 andere Kupfer-Zubereitungen.

**Insektizide / Akarizide / Nematizide:**

Abamectin, ABG-9008, Acephate, Acequinocyl, Acetamiprid, Acetoprole, Acrinathrin, AKD-1022, AKD-3059, AKD-3088, Alanycarb, Aldicarb, Aldoxycarb, Allethrin, Allethrin 1R-isomers, Alpha-Cypermethrin (Alphamethrin), Amidoflomet, Aminocarb, Amitraz, Avermectin, AZ-60541,  
25 Azadirachtin, Azamethiphos, Azinphos-methyl, Azinphos-ethyl, Azocyclotin,

- Bacillus popilliae, Bacillus sphaericus, Bacillus subtilis, Bacillus thuringiensis, Bacillus thuringiensis strain EG-2348, Bacillus thuringiensis strain GC-91, Bacillus thuringiensis strain NCTC-11821, Baculoviren, Beauveria bassiana, Beauveria tenella, Bendiocarb, Benfuracarb, Bensultap, Benzoximate, Beta-Cyfluthrin, Beta-Cypermethrin, Bifenazate, Bifenthrin, Binapacryl, Bio-
- 5 allethrin, Bioallethrin-S-cyclopentyl-isomer, Bioethanomethrin, Biopermethrin, Bioresmethrin, Bistrifluron, BPMC, Brofenprox, Bromophos-ethyl, Bromopropylate, Bromfenvinfos (-methyl), BTG-504, BTG-505, Bufencarb, Buprofezin, Butathiofos, Butocarboxim, Butoxycarboxim, Butylpyridaben,
- Cadusafos, Camphechlor, Carbaryl, Carbofuran, Carbophenothion, Carbosulfan, Cartap, CGA-
- 10 50439, Chinomethionat, Chlordane, Chlordimeform, Chloethocarb, Chlorethoxyfos, Chlorfenapyr, Chlorfenvinphos, Chlorfluazuron, Chlormephos, Chlorobenzilate, Chloropicrin, Chlorproxyfen, Chlorpyrifos-methyl, Chlorpyrifos (-ethyl), Chlovaporthrin, Chromafenozide, Cis-Cypermethrin, Cis-Resmethrin, Cis-Permethrin, Clocythrin, Cloethocarb, Clofentezine, Clothianidin, Clothiazoben, Codlemone, Coumaphos, Cyanofenphos, Cyanophos, Cycloprene, Cycloprothrin, Cydia
- 15 pomonella, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cyhexatin, Cypermethrin, Cyphenothrin (1R-trans-isomer), Cyromazine,
- DDT, Deltamethrin, Demeton-S-methyl, Demeton-S-methylsulphon, Diafenthiuron, Dialifos, Diazinon, Dichlofenthion, Dichlorvos, Dicofol, Dicrotophos, Dicyclanil, Diflubenzuron, Dimethoate, Dimethylvinphos, Dinobuton, Dinocap, Dinotefuran, Diofenolan, Disulfoton, Docusat-sodium,
- 20 Dofenapyn, DOWCO-439,
- Eflusilanate, Enamectin, Enamectin-benzoate, Empenthrin (1R-isomer), Endosulfan, Entomophthora spp., EPN, Esfenvalerate, Ethiofencarb, Ethiprole, Ethion, Ethoprophos, Etofenprox, Etoxazole, Etrimfos,
- Famphur, Fenamiphos, Fenazaquin, Fenbutatin oxide, Fenfluthrin, Fenitrothion, Fenobucarb,
- 25 Fenothiocarb, Fenoxacrim, Fenoxycarb, Fenpropathrin, Fenpyrad, Fenpyrithrin, Fenpyroximate, Fensulfothion, Fenthion, Fentrifanil, Fenvalerate, Fipronil, Flonicamid, Fluacrypyrim, Fluazuron, Flubenzimine, Flubrocylthrin, Flucycloxuron, Flucythrinate, Flufenerim, Flufenoxuron, Flufenprox, Flumethrin, Flupyrzofos, Flutenzin (Flufenzine), Fluvalinate, Fonofos, Formetanate, Formothion, Fosmethilan, Fosthiazate, Fubfenprox (Fluproxyfen), Furathiocarb,
- 30 Gamma-HCH, Gossypure, Grandlure, Granuloseviren,
- Halfenprox, Halofenozide, HCH, HCN-801, Heptenophos, Hexaflumuron, Hexythiazox, Hydramethylnone, Hydroprene,

- IKA-2002, Imidacloprid, Imiprothrin, Indoxacarb, Iodofenphos, Iprobenfos, Isazofos, Isofenphos, Isoprocarb, Isoxathion, Ivermectin,
- Japonilure,
- Kadethrin, Kernpolyederviren, Kinoprene,
- 5 Lambda-Cyhalothrin, Lindane, Lufenuron,
- Malathion, Mecarbam, Mesulfenfos, Metaldehyd, Metam-sodium, Methacrifos, Methamidophos, Metharhizium anisopliae, Metharhizium flavoviride, Methidathion, Methiocarb, Methomyl, Methoprene, Methoxychlor, Methoxyfenozide, Metolcarb, Metoxadiazone, Mevinphos, Milbemectin, Milbemycin, MKI-245, MON-45700, Monocrotophos, Moxidectin, MTI-800,
- 10 Naled, NC-104, NC-170, NC-184, NC-194, NC-196, Niclosamide, Nicotine, Nitenpyram, Nithiazine, NNI-0001, NNI-0101, NNI-0250, NNI-9768, Novaluron, Noviflumuron,
- OK-5101, OK-5201, OK-9601, OK-9602, OK-9701, OK-9802, Omethoate, Oxamyl, Oxydemeton-methyl,
- Paecilomyces fumosoroseus, Parathion-methyl, Parathion (-ethyl), Permethrin (cis-, trans-),
- 15 Petroleum, PH-6045, Phenothrin (1R-trans isomer), Phenthoate, Phorate, Phosalone, Phosmet, Phosphamidon, Phosphocarb, Phoxim, Piperonyl butoxide, Pirimicarb, Pirimiphos-methyl, Pirimiphos-ethyl, Prallethrin, Profenofos, Promecarb, Propaphos, Propargite, Propetamphos, Propoxur, Prothiofos, Prothoate, Protrifenbute, Pymetrozine, Pyraclofos, Pyresmethrin, Pyrethrum, Pyridaben, Pyridalyl, Pyridaphenthion, Pyridathion, Pyrimidifen, Pyriproxyfen,
- 20 Quinalphos,
- Resmethrin, RH-5849, Ribavirin, RU-12457, RU-15525,
- S-421, S-1833, Salithion, Sebufos, SI-0009, Silafluofen, Spinosad, Spirodiclofen, Spiromesifen, Sulfluramid, Sulfotep, Sulprofos, SZI-121,
- Tau-Fluvalinate, Tebufenozide, Tebufenpyrad, Tebupirimfos, Teflubenzuron, Tefluthrin, Temephos, Temvinphos, Terbam, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Tetradifon, Tetramethrin, Tetramethrin (1R-isomer), Tetrasul, Theta-Cypermethrin, Thiacloprid, Thiamethoxam, Thiapronil, Thiatriphos, Thiocyclam hydrogen oxalate, Thiodicarb, Thiofanox, Thiometon, Thiosultap-sodium, Thuringiensin, Tolfenpyrad, Traloccythrin, Tralomethrin, Transfluthrin, Triarathene, Triazamate, Triazophos, Triazuron, Trichlophenidine, Trichlorfon, Triflumuron, Trimethacarb,

Vamidothion, Vaniliprole, Verbutin, Verticillium lecanii,

WL-108477, WL-40027,

YI-5201, YI-5301, YI-5302,

XMC, Xylylcarb,

- 5 ZA-3274, Zeta-Cypermethrin, Zolaprofos, ZXI-8901,

die Verbindung 3-Methyl-phenyl-propylcarbammat (Tsumacide Z),

die Verbindung 3-(5-Chlor-3-pyridinyl)-8-(2,2,2-trifluorethyl)-8-azabicyclo[3.2.1]octan-3-carbonitril (CAS-Reg.-Nr. 185982-80-3) und das entsprechende 3-endo-Isomere (CAS-Reg.-Nr. 185984-60-5) (vgl. WO-96/37494, WO-98/25923),

- 10 sowie Präparate, welche insektizid wirksame Pflanzenextrakte, Nematoden, Pilze oder Viren enthalten.

Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Herbiziden oder mit Düngemitteln und Wachstumsregulatoren, Safenern bzw. Semiochemicals ist möglich.

- 15 Darüber hinaus weisen die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) auch sehr gute antimykotische Wirkungen auf. Sie besitzen ein sehr breites antimykotisches Wirkungsspektrum, insbesondere gegen Dermatophyten und Sprosspilze, Schimmel und diphasische Pilze (z.B. gegen Candida-Spezies wie Candida albicans, Candida glabrata) sowie Epidermophyton floccosum, Aspergillus-Spezies wie Aspergillus niger und Aspergillus fumigatus, Trichophyton-Spezies wie Trichophyton mentagrophytes, Microsporon-Spezies wie Microsporon canis und audouinii. Die
- 20 Aufzählung dieser Pilze stellt keinesfalls eine Beschränkung des erfassbaren mykotischen Spektrums dar, sondern hat nur erläuternden Charakter.

- Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Spritzpulver, Pasten, lösliche Pulver, Stäubemittel und Granulate angewendet werden. Die Anwendung geschieht in üblicher
- 25 Weise, z.B. durch Gießen, Verspritzen, Versprühen, Verstreuen, Verstäuben, Verschäumen, Bestreichen usw. Es ist ferner möglich, die Wirkstoffe nach dem Ultra-Low-Volume-Verfahren auszubringen oder die Wirkstoffzubereitung oder den Wirkstoff selbst in den Boden zu injizieren. Es kann auch das Saatgut der Pflanzen behandelt werden.

Beim Einsatz der erfindungsgemäßen Wirkstoffe als Fungizide können die Aufwandmengen je nach Applikationsart innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Bei der Behandlung von Pflanzenteilen liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugsweise zwischen 10 und 1.000 g/ha. Bei der Saatgutbehandlung liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,001 und 50 g pro Kilogramm Saatgut, vorzugsweise zwischen 0,01 und 10 g pro Kilogramm Saatgut. Bei der Behandlung des Bodens liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugsweise zwischen 1 und 5.000 g/ha.

Wie bereits oben erwähnt, können erfindungsgemäß alle Pflanzen und deren Teile behandelt werden. In einer bevorzugten Ausführungsform werden wild vorkommende oder durch konventionelle biologische Zuchtmethoden, wie Kreuzung oder Protoplastenfusion erhaltenen Pflanzenarten und Pflanzensorten sowie deren Teile behandelt. In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform werden transgene Pflanzen und Pflanzensorten, die durch gentechnologische Methoden gegebenenfalls in Kombination mit konventionellen Methoden erhalten wurden (Genetically Modified Organisms) und deren Teile behandelt. Der Begriff „Teile“ bzw. „Teile von Pflanzen“ oder „Pflanzenteile“ wurde oben erläutert.

Besonders bevorzugt werden erfindungsgemäß Pflanzen der jeweils handelsüblichen oder in Gebrauch befindlichen Pflanzensorten behandelt. Unter Pflanzensorten versteht man Pflanzen mit neuen Eigenschaften („Traits“), die sowohl durch konventionelle Züchtung, durch Mutagenese oder durch rekombinante DNA-Techniken gezüchtet worden sind. Dies können Sorten, Rassen, Bio- und Genotypen sein.

Je nach Pflanzenarten bzw. Pflanzensorten, deren Standort und Wachstumsbedingungen (Böden, Klima, Vegetationsperiode, Ernährung) können durch die erfindungsgemäße Behandlung auch überadditive („synergistische“) Effekte auftreten. So sind beispielsweise erniedrigte Aufwandmengen und/oder Erweiterungen des Wirkungsspektrums und/oder eine Verstärkung der Wirkung der erfindungsgemäß verwendbaren Stoffe und Mittel, besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte möglich, die über die eigentlich zu erwartenden Effekte hinausgehen.

Zu den bevorzugten erfindungsgemäß zu behandelnden transgenen (gentechnologisch erhaltenen) Pflanzen bzw. Pflanzensorten gehören alle Pflanzen, die durch die gentechnologische Modifi-

kation genetisches Material erhielten, welches diesen Pflanzen besondere vorteilhafte wertvolle Eigenschaften („Traits“) verleiht. Beispiele für solche Eigenschaften sind besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte. Weitere und besonders hervorgehobene Beispiele für solche Eigenschaften sind eine erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen tierische und mikrobielle Schädlinge, wie gegenüber Insekten, Milben, pflanzenpathogenen Pilzen, Bakterien und/oder Viren sowie eine erhöhte Toleranz der Pflanzen gegen bestimmte herbizide Wirkstoffe. Als Beispiele transgener Pflanzen werden die wichtigen Kulturpflanzen, wie Getreide (Weizen; Reis), Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle, Tabak, Raps sowie Obstpflanzen (mit den Früchten Äpfel, Birnen, Zitrusfrüchten und Weintrauben) erwähnt, wobei Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle, Tabak und Raps besonders hervorgehoben werden. Als Eigenschaften („Traits“) werden besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen Insekten, Spinnentiere, Nematoden und Schnecken durch in den Pflanzen entstehende Toxine, insbesondere solche, die durch das genetische Material aus *Bacillus Thuringiensis* (z.B. durch die Gene CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb und CryIF sowie deren Kombinationen) in den Pflanzen erzeugt werden (im folgenden "Bt Pflanzen"). Als Eigenschaften („Traits“) werden auch besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr von Pflanzen gegen Pilze, Bakterien und Viren durch Systemische Akquirierte Resistenz (SAR), Systemin, Phytoalexine, Elicitoren sowie Resistenzgene und entsprechend exprimierte Proteine und Toxine. Als Eigenschaften („Traits“) werden weiterhin besonders hervorgehoben die erhöhte Toleranz der Pflanzen gegenüber bestimmten herbiziden Wirkstoffen, beispielsweise Imidazolinonen, Sulfonylharnstoffen, Glyphosate oder Phosphinotricin (z.B. "PAT"-Gen). Die jeweils die gewünschten Eigenschaften („Traits“) verleihenden Gene können auch in Kombinationen miteinander in den transgenen Pflanzen vorkommen. Als Beispiele für "Bt Pflanzen" seien Maissorten, Baumwollsorten, Sojasorten und Kartoffelsorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen YIELD GARD® (z.B. Mais, Baumwolle, Soja), KnockOut® (z.B. Mais), StarLink® (z.B. Mais), Bollgard® (Baumwolle), Nucoton® (Baumwolle) und NewLeaf® (Kartoffel) vertrieben werden. Als Beispiele für Herbizid tolerante Pflanzen seien Maissorten, Baumwollsorten und Sojasorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen Roundup Ready® (Toleranz gegen Glyphosate z.B. Mais, Baumwolle, Soja), Liberty Link® (Toleranz gegen Phosphinotricin, z.B. Raps), IMI® (Toleranz gegen Imidazolinone) und STS® (Toleranz gegen Sulfonylharnstoffe z.B. Mais) vertrieben werden. Als Herbizid resistente (konventionell auf Herbizid-Toleranz gezüchtete) Pflanzen seien auch die unter der Bezeichnung Clearfield® vertrie-

benen Sorten (z.B. Mais) erwähnt. Selbstverständlich gelten diese Aussagen auch für in der Zukunft entwickelte bzw. zukünftig auf den Markt kommende Pflanzensorten mit diesen oder zukünftig entwickelten genetischen Eigenschaften („Traits“).

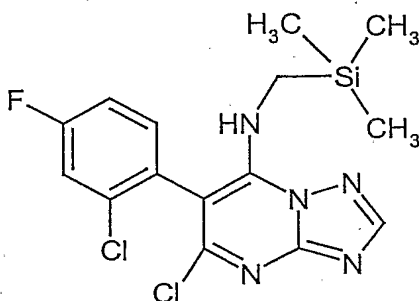
5 Die aufgeführten Pflanzen können besonders vorteilhaft erfindungsgemäß mit den Verbindungen der allgemeinen Formel (I) bzw. den erfindungsgemäßen Wirkstoffmischungen behandelt werden. Die bei den Wirkstoffen bzw. Mischungen oben angegebenen Vorzugsbereiche gelten auch für die Behandlung dieser Pflanzen. Besonders hervorgehoben sei die Pflanzenbehandlung mit den im vorliegenden Text speziell aufgeführten Verbindungen bzw. Mischungen.

10 Weiterhin eignen sich die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) zur Unterdrückung des Wachstums von Tumorzellen in Menschen und Säugetieren. Dies basiert auf einer Wechselwirkung der erfindungsgemäßen Verbindungen mit Tubulin und Mikrotubuli und durch Förderung der Mikrotubuli-Polymerisation.

Zu diesem Zweck kann man eine wirksame Menge an einer oder mehreren Verbindungen der Formel (I) oder pharmazeutisch verträglicher Salze davon verabreichen.

15 Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geht aus den folgenden Beispielen hervor.



**Beispiel 1**

- 5 Zu einer Lösung von 0,400 g (1,260 mmol) 5,7-Dichlor-6-(2-chlor-4-fluorphenyl)-[1,2,4]triazolo-[1,5-a]pyrimidin in 10 ml Acetonitril gab man bei Raumtemperatur 0,143 g (1,386 mmol) Trimethylsilylmethylamin und 0,216 g (1,890 mmol)  $K_2CO_3$  und rührte dann über Nacht. Anschließend wurde in Salzsäure eingerührt, das ausgefallene Produkt mit Wasser gewaschen und getrocknet. Man erhielt 0,31 g (58 % d.Th.) Produkt.

HPLC:  $\log P = 3,61$

**Beispiel 2**

- 10 a) Herstellung von (1-Iodethyl)trimethylsilan

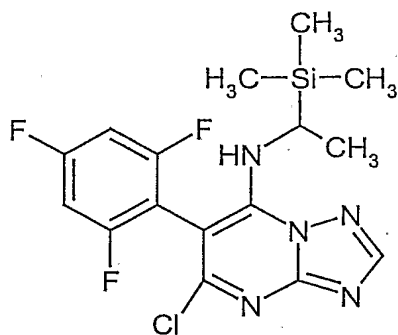
2,4 g (17,557 mmol) (1-Chlorethyl)trimethylsilan wurde in 15 ml Aceton verrührt, mit 6,579 g (43,893 mmol) Natriumiodid versetzt und 1 Tag am Rückfluss gekocht. Es wurde in Wasser und Ether aufgenommen und die wässrige Phase zweimal mit Ether extrahiert. Die organische Phase wurde getrocknet und das Lösungsmittel abgezogen.

- 15 Man erhielt 3,8 g (95 % d.Th.) Produkt.

- b) (1-Aminoethyl)trimethylsilan

- 3,8 g (16,656 mmol) (1-Iodmethyl)trimethylsilan wurden im Autoklaven mit 47,670 g (2799,014 mmol) Ammoniak einkondensiert und 2,5 Stunden bei 135°C und einem Druck von 91 bar gerührt. Das Reaktionsgemisch wurde in  $CH_2Cl_2$  verrührt, das Lösungsmittel abgezogen  
20 mit 6n Natronlauge versetzt und mit Ether extrahiert. Nach Abzug des Esters erhielt man 1,4 g (70 % d.Th.) Produkt

c)

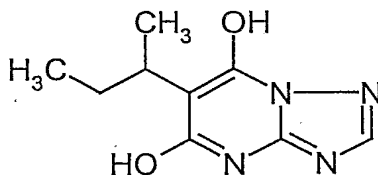


Zu einer Lösung von 0,500 g (1,567 mmol) 5,7-Dichlor-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-[1,2,4]triazolo-  
[1,5-a]pyrimidin in 10 ml Acetonitril und 0,202 g (1,724 mmol) 1-(Trimethylsilyl)ethylamin gab  
man bei Raumtemperatur 0,217 g (1,567 mmol)  $K_2CO_3$ , rührte über Nacht bei Raumtemperatur  
und anschließend noch 6 Stunden bei 60°C. Man zog das Lösungsmittel im Vakuum ab, nahm in  
 $CH_2Cl_2$  und 1N Salzsäure auf. Nach Trocknen und Einengen der organischen Phase wurde der  
verbleibende Rückstand chromatographisch (Petrolether/Methylisobutylketon 3:1) gereinigt. Man  
erhielt 0,35 g (51 % d.Th.) Produkt.

HPLC:  $\log P = 3,71$

## 10 Beispiel 25

a)

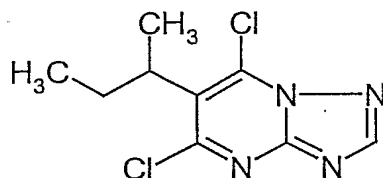


2,6 g (0,012 Mol) sec-Butylmalonsäurediethylester wurden in 9,5 g Dimethylformamid vorgelegt.  
Bei Raumtemperatur wurden 1g (0,012 Mol) 3-Amino-1,2,4-Triazol und 1,8 g (0,013 Mol) 1,8-  
Diazabicyclo(5.4.0)undec-7-en zugegeben. Die Mischung wurde 6 Stunden bei 100°C gerührt.  
Dann wurde sie auf Wasser gegossen und mit Chloroform extrahiert. Die wässrige Phase wurde  
eingengt und der verbleibende Rückstand mit konz. Salzsäure verrührt, abgesaugt und getrocknet.

Man erhielt 0,5 g 6-sec-Butyl-7-hydroxy[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-5(4H)-on ( $\log p = 0,70$ ;

20 HPCL-Gehalt: 96,2 %).

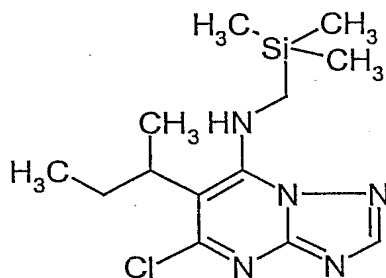
b)



2,6 g (0,093 Mol) sec-Butylmalonsäurediethylester wurden mit 7,8 g (0,093 Mol) 3-Amino-1,2,4-Triazol und 19 g (0,102 Mol) Tri-n-butylamin vermischt und 6 Stunden bei 180°C unter  
5 Abdestillieren des bei der Reaktion entstehenden Ethanol gerührt. Danach wurden bei 10 Torr flüchtige Komponenten abdestilliert. Der Rückstand wurde ohne Reinigung weiter umgesetzt.

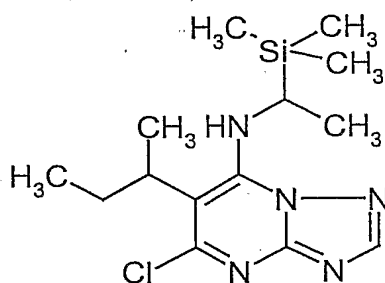
Das rohe 6-sec-Butyl-7-hydroxy[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-5(4H)-on wurde in 8,9 g (0,827 Mol) Phosphorylchlorid gelöst und es wurden 11 g (0,053 Mol) Phosphorpentachlorid bei Raumtemperatur zugegeben. Man erhitzte das Reaktionsgemisch 3 Stunden auf 110°C. Dann  
10 entfernte man bei 10 Torr flüchtige Komponenten, nahm den Rückstand in Dichlormethan auf und wusch die Lösung mit Eiswasser. Nach Trocknen und Abdestillieren des Lösungsmittels wurde der Rückstand in einer Mischung von Petrolether : tert.-Butylmethylether = 2:1 auf Kieselgel chromatographiert. Man erhielt 3,5 g 5,7-Dichlor-6-sec-Butyl[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin (log p = 2,40; HPLC-Gehalt: 96,4 %).

15 c)



0,5 g (0,002 Mol) 5,7-Dichlor-6-sec-butyl[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin wurden in 7,8 g Acetonitril vorgelegt. Man gab 0,7 g (0,005 Mol) Kaliumcarbonat und 0,31 g (0,002 Mol) 2-Trimethylsilyl-1-aminoethan zu. Das Reaktionsgemisch wurde 16 Stunden bei Raumtemperatur gerührt.  
20 Dann wurde es mit Salzsäure sauer gestellt und mit Diethylether extrahiert. Die organische Phase wurde getrocknet und eingengt. Der Rückstand wurde mit Diethylether verrührt und dann in einem Gemisch von Cyclohexan : Essigsäureethylester = 8: 2 auf Kieselgel chromatographiert.

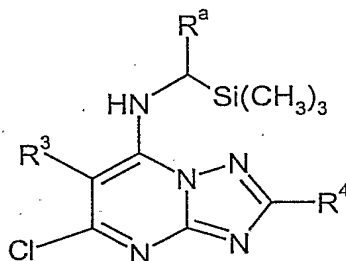
Man erhielt 0,3 g 5-Chlor-6-sec-butyl-7-(1-trimethylsilylethylamino)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin (log p = 3,87; HPLC-Gehalt: 93 %).

**Beispiel 26**

0,5 g (0,002 Mol) 5,7-Dichlor-6-sec-butyl[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin wurden in 7,8 g Acetonitril vorgelegt. Man gab 0,42 g (0,003 Mol) Kaliumcarbonat und 0,21 g (0,002 Mol) Trimethylsilylmethylamin zu. Das Reaktionsgemisch wurde 16 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Dann wurde es mit Salzsäure sauer gestellt und mit Diethylether extrahiert. Die organische Phase wurde getrocknet und eingeeengt. Der Rückstand wurde mit Diethylether verrührt und dann abgesaugt. Man erhielt 0,24 g 5-Chlor-6-sec-butyl-7-trimethylsilylmethylamino[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin (log p = 3,34; HPLC-Gehalt: 100 %).

Analog zu den zuvor angegebenen Methoden werden bzw. wurden auch die in der nachstehenden Tabelle 1 aufgeführten Verbindungen der Formel (I) erhalten.

### Tabelle 1



Bsp. Nr.	R <sup>a</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	logP	Fp. (°C)
1	H	2-Cl-4-F-Phenyl	H	3,61	
2	CH <sub>3</sub>	2,4,6-Trifluorophenyl	H	3,71	
3	H	2-Cl-6-F-Phenyl	H	3,43	
4	H	2,4,6-Trifluorophenyl	H	3,39	
5	CH <sub>3</sub>	2-Cl-6-F-Phenyl	H	3,79	
6	CH <sub>3</sub>	2-Cl-4-F-Phenyl	H	3,95	
7	CH <sub>3</sub>	2-Cl-Phenyl	H	3,83	
8	H	3-Cl-5-(CF <sub>3</sub> )-Pyridin-2-yl	i-Propyl	4,51	
9	CH <sub>3</sub>	5-F-Pyrimidin-4-yl	i-Propyl	3,61	
10	CH <sub>3</sub>	3-(CF <sub>3</sub> )-Pyridin-2-yl	H	3,06	
11	CH <sub>3</sub>	2-Cl-6-F-Phenyl	Cyclopropyl	4,65	
12	H	2-Cl-6-F-Phenyl	Cyclopropyl	4,22	
13	H	2,5-Difluorophenyl	Cyclopropyl	3,99	
14	CH <sub>3</sub>	2,5-Difluorophenyl	Cyclopropyl	4,35	
15	CH <sub>3</sub>	2,5-Difluorophenyl	i-Propyl	4,58	
16	H	2,5-Difluorophenyl	i-Propyl	4,21	
17	CH <sub>3</sub>	2,5-Difluorophenyl	Methyl	3,73	
18	H	2,5-Difluorophenyl	Methyl	3,40	
19	CH <sub>3</sub>	5-F-Pyrimidin-4-yl	Cyclopropyl	2,99	
20	H	2-Cl-Phenyl	Cyclopropyl	4,23	

Bsp. Nr.	R <sup>a</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	logP	Fp. (°C)
21	CH <sub>3</sub>	2-Cl-Phenyl	Cyclopropyl	4,66	
22	H	5-F-Pyrimidin-4-yl	Cyclopropyl	3,02	
23	CH <sub>3</sub>	5-Cl-Pyrimidin-4-yl	H	2,70	
24	H	5-Cl-Pyrimidin-4-yl	H	2,44	
25	CH <sub>3</sub>	sec-Butyl	H	3,87	
26	H	sec-Butyl	H	3,34	
27	H	5-F-Pyrimidin-4-yl	Methyl	2,43	
28	CH <sub>3</sub>	5-F-Pyrimidin-4-yl	Methyl	2,73	
29	H	N(-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -)	H		
30	CH <sub>3</sub>	N(-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -)	H		
31	H	N(-CHCH <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -)	H		
32	H	N(-CHCH <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -)	H		
33	H	N(-CHCH <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -)	H		
34	CH <sub>3</sub>	N(-CHCH <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -)	H		
35	H	3,5-Dimethylpyrazol-1-yl	H		
36	CH <sub>3</sub>	3,5-Dimethylpyrazol-1-yl	H		
37	H	N(CH <sub>3</sub> )(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )	H		
38	CH <sub>3</sub>	N(CH <sub>3</sub> )(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )	H		

Die Bestimmung der logP-Werte erfolgte gemäß EEC-Directive 79/831 Annex V. A8 durch HPLC (Gradientenmethode, Acetonitril/0,1 % wässrige Phosphorsäure.

### Verwendungsbeispiele

#### Beispiel A

Podosphaera-Test (Apfel) / protektiv

Lösungsmittel : 24,5 Gewichtsteile Aceton

5 24,5 Gewichtsteile Dimethylacetamid

Emulgator : 1 Gewichtsteil Alkyl-Aryl-Polyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

10 Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wässrigen Sporensuspension des Apfelmehltauenerregers *Podosphaera leucotricha* inokuliert. Die Pflanzen werden dann im Gewächshaus bei ca. 23°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von ca. 70% aufgestellt.

15 10 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0% ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100% bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

In diesem Test zeigten die erfindungsgemäßen Stoffe der Beispiele 1, 2, 3, 4, 5 und 6 bei einer Aufwandmenge von 100 g/ha einen Wirkungsgrad von über 90 %.

Beispiel B

Venturia - Test (Apfel) / protektiv

Lösungsmittel : 24,5 Gewichtsteile Aceton

24,5 Gewichtsteile Dimethylacetamid

5 Emulgator : 1 Gewichtsteil Alkyl-Aryl-Polyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

10 Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wässrigen Konidien suspension des Apfelschorferregers *Venturia inaequalis* inokuliert und verbleiben dann 1 Tag bei ca. 20°C und 100% relativer Luftfeuchtigkeit in einer Inkubationskabine.

15 Die Pflanzen werden dann im Gewächshaus bei ca. 21°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von ca. 90% aufgestellt.

10 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0% ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100% bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

20 In diesem Test zeigten die erfindungsgemäßen Stoffe der Beispiele 1, 2, 3, 4, 5 und 6 bei einer Aufwandmenge von 100 g/ha einen Wirkungsgrad von über 90 %.



Beispiel C

Botrytis - Test (Bohne) / protektiv

Lösungsmittel : 24,5 Gewichtsteile Aceton

24,5 Gewichtsteile Dimethylacetamid

5 Emulgator : 1 Gewichtsteil Alkyl-Aryl-Polyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

10 Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden auf jedes Blatt 2 kleine mit Botrytis cinerea bewachsene Agarstückchen aufgelegt. Die inokulierten Pflanzen werden in einer abgedunkelten Kammer bei ca. 20°C und 100% relativer Luftfeuchtigkeit aufgestellt.

2 Tage nach der Inokulation wird die Größe der Befallsflecken auf den Blättern ausgewertet.  
15 Dabei bedeutet 0% ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100% bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

In diesem Test zeigten die erfindungsgemäßen Stoffe der Beispiele 1, 2, 4 und 6 bei einer Aufwandmenge von 500 g/ha einen Wirkungsgrad von über 90 %.

Beispiel D

Sphaerotheca-Test (Gurke) / protektiv

Lösungsmittel: 49 Gewichtsteile N, N - Dimethylformamid

Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

- 5 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

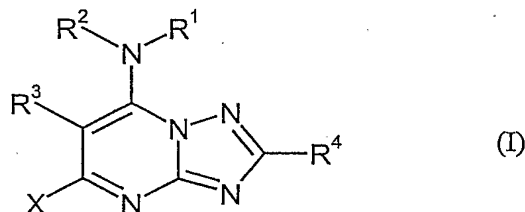
- 10 Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit bespritzt man junge Gurkenpflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge. 1 Tag nach der Behandlung werden die Pflanzen mit einer Sporensuspension von *Sphaerotheca fuliginea* inokuliert. Anschließend werden die Pflanzen in einem Gewächshaus bei 70 % relativer Luftfeuchtigkeit und einer Temperatur von 23 °C aufgestellt.

- 15 7 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

Bei diesem Test zeigten die erfindungsgemäßen Stoffe der Beispiele 4, 14, 15 und 17 bei einer Aufwandmenge von 750 g/ha einen Wirkungsgrad von über 90 %.

Patentansprüche

## 1. Triazolopyrimidine der Formel



in welcher

$R^1$  für H,  $R^2$ , gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Alkynyl, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl oder für gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl steht,

$R^2$  für einen organischen Rest steht, der 3 bis 13 Kohlenstoffatome und ein oder mehrere Siliziumatome enthält, sowie gegebenenfalls 1 bis 3 gleiche oder verschiedene Heteroatome aus der Gruppe Sauerstoff, Stickstoff und Schwefel, und unsubstituiert ist oder substituiert durch 1 bis 4 gleiche oder verschiedene Halogene, oder

$R^1$  und  $R^2$  gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen gegebenenfalls substituierten heterocyclischen Ring stehen, der ein oder mehrere Siliziumatome enthält und/oder durch einen oder mehrere Reste  $R^2$  substituiert ist,

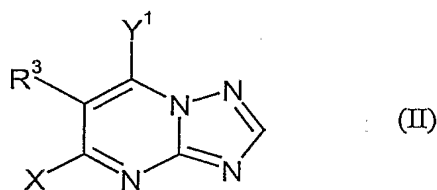
$R^3$  für gegebenenfalls substituiertes Aryl, gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Alkynyl, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl, gegebenenfalls substituiertes Aralkyl, oder gegebenenfalls substituierte Aminogruppe, gegebenenfalls substituiertes (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkoxy, gegebenenfalls substituiertes (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-Alkylthio, gegebenenfalls substituiertes (C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)-Aryloxy, gegebenenfalls substituiertes (C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)-Arylthio, gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl-oxy, gegebenenfalls substituiertes Heterocycliloxy, gegebenenfalls substituiertes C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>-Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkoxy, gegebenenfalls substituiertes (C<sub>6</sub>-C<sub>10</sub>)-Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkylthio, gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkoxy, oder gegebenenfalls substituiertes Heterocyclyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkylthio;

$R^4$  für H, Halogen, gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl oder gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Cycloalkyl steht und

X für Halogen, Cyano, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Alkoxy oder gegebenenfalls substituiertes Phenyl steht.

5 2. Verfahren zur Herstellung von Triazolopyrimidinen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man

(a) Halogentriazolopyrimidine der Formel

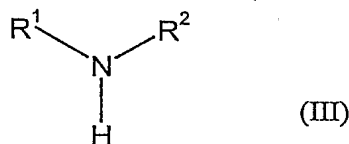


in welcher

10  $R^3$  und X die oben angegebenen Bedeutungen haben und

$Y^1$  für Halogen steht,

mit Aminen der Formel



in welcher

15  $R^1$  und  $R^2$  die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators umgesetzt.

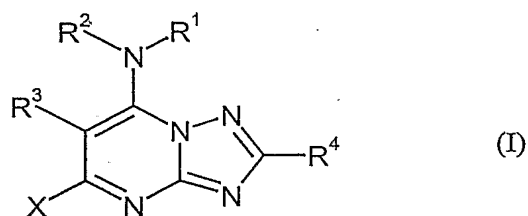
3. Mittel zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einem Triazolopyrimidin der Formel (I) gemäß Anspruch 1  
20 neben Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen.

4. Verwendung von Triazolopyrimidinen der Formel (I) gemäß Anspruch 1 zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen.
5. Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, dadurch gekennzeichnet, dass man Triazolopyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch 1 auf die unerwünschten Mikroorganismen und/oder deren Lebensraum ausbringt.
6. Verfahren zur Herstellung von Mitteln zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, dadurch gekennzeichnet, dass man Triazolopyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch 1 mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen vermischt.

Triazolopyrimidine

## Zusammenfassung

Triazolopyrimidine der Formel



in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  und X die in der Beschreibung angegebenen Bedeutungen haben,

ein Verfahren zur Herstellung dieser Stoffe und deren Verwendung zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen.